

① 日本国特許庁
公開特許公報

①特開昭 49-102616
②公開日 昭49.(1974) 9.27
③特願昭 48-17888
④出願日 昭47.(1972)10.30
審査請求 未請求 (全3頁)

庁内整理番号 ⑤日本分類

6664 43 16 B661
7043 44 30 B4

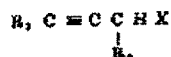
特許庁長官 殿
1. 発明の名称 プロピニルメルカプト酢酸
酢酸誘導体の製造法
2. 原特許出願の表示 昭和48年特許第114755号
(昭和47年10月30日特許第114755号)
発明者 提出
住所 神奈川県平塚市中原1006
氏名 青 川 三 雄 外2名
特許出願人 住所 東京都中央区京橋4丁目5番地
(609) 名称 明治製菓株式会社
代表者 中 川 雄
代理人 住 所 〒105 東京都港区西新橋1丁目2番9号
三井物産館内 電話(591)0261番
(2400) 氏名 金 丸 敬 男 外2名

明 細 書

1. 発明の名称
プロピニルメルカプト酢酸誘導体の製造法

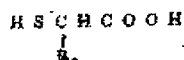
2. 特許請求の範囲

一般式

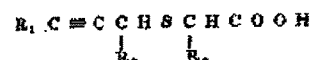


〔式中 R_1 および R_2 は水素原子または低級アルキル基を示し、 X はハロゲン原子を示す〕で表わされるプロピニルハロゲン誘導体

一般式



〔式中 R_2 は水素原子または低級アルキル基を示す〕で表わされるメルカプト酢酸誘導体又はこれの塩基塩基の存在下に又は不存在下に反応させることを特徴とする。一般式

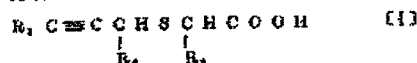


〔式中 R_1 、 R_2 および R_3 は、前述したものと同意

義を示す〕で表わされるプロピニルメルカプト酢酸誘導体又はこれの塩の製造法。

3. 発明の詳細な説明

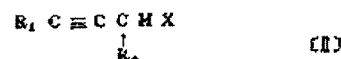
本発明は一般式



〔式中 R_1 、 R_2 、 R_3 は水素原子または低級アルキル基を示す〕で表わされる新規なプロピニルメルカプト酢酸誘導体又はこれの塩の製造法に関するものである。

本発明の方法によつて製造される一般式 [I] で示されるプロピニルメルカプト酢酸誘導体は、文獻記載の新規な化合物であつて抗炎症作用を有する有用なものであり、かつ医薬品合成の中間体としても極めて有用である。

本発明の方法によれば、前記 [I] 式を有するプロピニルメルカプト酢酸誘導体又はこれの塩は、一般式



〔式中 R_1 および R_2 は、前述したものと同意義を示し、 X はハロゲン原子、特に臭素又は塩素原子を示す〕で表わされるプロピニルハロゲン誘導体の一般式



〔式中 R_1 は、前述したものと同意義を示す〕で表わされるメルカプト酢酸誘導体又はこれの塩を塩基の存在下に又は不存在下に反応させることによつて製造される。本発明の方法を実施するに当つては、アルカリ水溶液またはアルコール中、塩基で約30時間反応を行うのが適当である。反応終了後、反応液を稀硫酸で酸性とし、有機溶媒で抽出する。溶媒を除去し、残留物を減圧蒸留または再結晶するなどの精製により逆限環の形の目的生成物が回収できる。塩基としては例えば水酸化アルカリ、アルカリ、アルコール、第三級アミン等が用い得る。反応剤(II)及び生成物(I)の塩は、例えばアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩、その他の上記反応並びに生體的に無害な塩であり

ルギルプロマイド1/9gと水酸化ナトリウム80gを水1.5に溶かした溶液を実施例1に準じて処理する。減圧蒸留すると沸点107~116°C/1mm Hgの2-(2-プロピニルメルカプト)プロピオン酸1/9gが得られる。冷却すると融点43~45°Cの結晶となる。

実施例3

メルカプト酢酸4.5g、3-プロペノールブテン60gと水酸化ナトリウム36gを水600mlに溶かした溶液を実施例1に準じて処理する。減圧蒸留すると沸点78~103°C/1mm Hgの3-メチル-1-プロピニルメルカプト酢酸2gが得られる。

実施例4

メルカプト酢酸14.7g、1-プロペノールブテン20gと水酸化ナトリウム12.3gを水150mlに溶かした溶液を実施例1に準じて処理する。減圧蒸留すると沸点117~120°C/0.5mm Hgの1-メチル-2-プロピニルメルカプト酢酸1.2gが得られる。

特開49-102615(2)

得る。

本発明の方法に使用される出発物質である一般式(II)のプロピニルハロゲン誘導体は文献既知の方法で合成することができる。

次に本発明の方法を実施例により具体的に説明するが、本発明はこれにより限定されるものではない。

実施例1

メルカプト酢酸100gを水酸化ナトリウム80gと水1.5の混合液に加え、30分間かきまぜる。この溶液にプロパルギル、プロマイド1/9gを滴下し、反応液を室温で30時間かきまぜる。次に稀硫酸を加えてpH2.5とし、エーテル抽出する。抽出液を乾燥後、蒸留し、母液を濃縮する。残留物を減圧蒸留すれば沸点110~113°C/2mm Hgの2-プロピニルメルカプト酢酸6.3gが得られる。このものは冷却すると融点39~41°Cの結晶となる。

実施例2

2-メルカプトプロピオン酸100g、プロパ

試験例

本発明の方法で製造された式(I)の化合物が抗炎症作用をもつことを例証するために、抗炎症作用の有無を示す尺度として、カラグエンによつて惹起される浮腫を抑制する効果を調べた。この目的で下記の供試化合物について3mg/ラット宛で腹腔内投与におけるカラグエン浮腫抑制率を常法で測定した。その結果を次表に示す。

供試化合物	抑制率(%)
2-プロピニルメルカプト酢酸	28.8
2-(2-プロピニルメルカプト)プロピオン酸	33.2
3-メチル-1-プロピニルメルカプト酢酸	22.8
1-メチル-2-プロピニルメルカプト酢酸	38.0

特開昭49-102616(3)

6. 添附書類の目録

- | | |
|----------|----|
| (1) 明細書 | 1通 |
| (2) 図面 | 1通 |
| (3) 委任状 | 1通 |
| (4) 願書副本 | 1通 |

特開昭49-102616(3)



7. 前記以外の発明者、代理人

(1) 発明者

住所 東京都文京区白山4-57-14

氏名 伊藤 藤一郎

住所 神奈川県横浜市港北区件手原1-5-12

氏名 佐藤 菊正

(2) 代理人

住所 東京都港区西新橋1丁目2番9号
三井物産館内

氏名 朝内 忠夫

~~住所 八木町~~ 茂

住所 浜野 孝雄

~~住所 森田 哲三~~ 雄